

ABSTRACT

A process for easily producing an optically active  $\beta$ -amino alcohol useful as a pharmaceutical intermediate from an inexpensive, readily available starting material is provided. A readily available  $\alpha$ -substituted ketone is reacted with an optically active amine to yield a diastereomer mixture of an optically active  $\alpha$ -substituted aminoketone. One of the diastereomers is isolated optionally after the diastereomers are converted to salts with an acid. The optically active  $\alpha$ -substituted aminoketone or a salt thereof thus isolated was stereoselectively reduced to yield an optically active  $\beta$ -substituted amino alcohol. The optically active  $\beta$ -substituted amino alcohol is subjected to hydrogenolysis to produce an optically active  $\beta$ -amino alcohol or a salt thereof.

(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

03 DEC 2004

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局



(43) 国際公開日  
2003年12月18日 (18.12.2003)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 03/104186 A1

(51) 国際特許分類: C07C 225/16, 221/00, 213/00, 215/28 // C07M 7:00, C07B 57/00

(74) 共通の代表者: 鎌淵化学工業株式会社 (KANEKA CORPORATION); 〒530-8288 大阪府 大阪市北区 中之島 3 丁目 2-4 Osaka (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP03/06959

(22) 国際出願日: 2003年6月2日 (02.06.2003)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ: 特願2002-170453 2002年6月11日 (11.06.2002) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 鎌淵化学工業株式会社 (KANEKA CORPORATION) [JP/JP]; 〒530-8288 大阪府 大阪市北区 中之島 3 丁目 2-4 Osaka (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 西山 章 (NISHIYAMA, Akira) [JP/JP]; 〒676-8688 兵庫県 高砂市高砂町宮前町 1-8 鎌淵化学工業株式会社 高砂工業所内 Hyogo (JP). 岸本 成己 (KISHIMOTO, Narumi) [JP/JP]; 〒676-8688 兵庫県 高砂市高砂町宮前町 1-8 鎌淵化学工業株式会社 高砂工業所内 Hyogo (JP). 長嶋 伸夫 (NAGASHIMA, Nobuo) [JP/JP]; 〒676-8688 兵庫県 高砂市高砂町宮前町 1-8 鎌淵化学工業株式会社 高砂工業所内 Hyogo (JP).

(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GI, GM, IIR, IIU, ID, II, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KV, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NL, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SI, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GI, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, BG, CI, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:  
— 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTがゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイドブック」を参照。

(54) Title: PROCESS FOR PRODUCING OPTICALLY ACTIVE  $\beta$ -AMINO ALCOHOL

(54) 発明の名称: 光学活性  $\beta$ -アミノアルコールの製造法

WO 03/104186 A1 (57) Abstract: A process for easily producing, from an easily available inexpensive starting material, an optically active  $\beta$ -amino alcohol useful as an intermediate for medicines. An easily available  $\alpha$ -substituted ketone is reacted with an optically active amine to produce a mixture of diastereomers of an optically active  $\alpha$ -substituted aminoketone. One of the diastereomers is separated optionally after the diastereomers are converted to a salt with an acid. The optically active  $\alpha$ -substituted aminoketone or salt thereof thus isolated is subjected to stereoselective reduction to produce an optically active  $\beta$ -substituted amino alcohol, which is then subjected to hydrogenolysis. Thus, an optically active  $\beta$ -amino alcohol or a salt thereof is produced.

(57) 要約: 医薬中間体として有用な光学活性  $\beta$ -アミノアルコールを、安価且つ入手容易な出発原料から簡便に製造できる方法を提供する。入手容易な  $\alpha$ -置換ケトンと光学活性アミンを反応させることにより、光学活性  $\alpha$ -置換アミノケトンのジアステレオマー混合物を製造し、必要に応じて酸との塩を形成させ、一方のジアステレオマーを分離することにより、光学活性  $\alpha$ -置換アミノケトン、又はその塩を単離し、さらに立体選択性的還元を行うことにより、光学活性  $\beta$ -置換アミノアルコールを製造し、さらに加水分解することにより、光学活性  $\beta$ -アミノアルコール、又はその塩を製造する。